



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyysw@sina.com

产品名称: **Etripamil**
CAS 号: **1593673-23-4**
产品货号: **T20493**

生物活性:

Description	Etripamil (MSP-2017) is a short-acting, L-type calcium-channel antagonist. Etripamil inhibits calcium influx through slow calcium channels, thereby slowing AV node conduction and prolonging the AV node refractory period. Etripamil increases heart rate and decreases systolic blood pressure. Etripamil can be used in the study of paroxysmal supraventricular tachycardia (PSVT)[1][2][3][4].				
IC50 & Target	L-type calcium channel				
In Vivo	Etripamil (0-0.3 mg/kg; 静脉注射) 在清醒遥测食蟹猴中表现出剂量依赖性收缩压下降、心率增加和 PR 间期增加[3]。 Etripamil (1.9-5.7 mg/kg; 鼻腔给药; 每周一次; 26 次给药) 不会引起食蟹猴的宏观或全身微观异常[4]。				
	Animal Model:	Chinese-origin cynomolgus monkeys (20 males and 20 females, body weights ranged from 2.5-3.1 kg for males and 2.3-2.9 kg for females, age ranged from 2.5-4.0 years at dosing onset)[4]			
	Dosage:	1.9 mg/kg, 3.8 mg/kg, 5.7 mg/kg.			
	Administration:	Intranasal administration using a single-use nasal spray device, weekly for 26 doses			
	Result:	Showed no mortality. Induced transient runny nose, sneezing, salivation, and vomiting (≥1.9 mg/kg/dose). Did not cause histological changes in the nasal cavity, larynx, and pharynx at ≥1.9 mg/kg/dose. Caused microscopic changes limited to the left nasal cavity and nasopharynx after a 28-day recovery period. Showed a systemic NOAEL of 5.7 mg/kg/dose and local toxicity NOAEL of 1.9 mg/kg/dose.			
Solvent&Solubility	细胞实验: Ethanol 中的溶解度 : 120 mg/mL (265.14 mM); 超声助溶				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.2095 mL	11.0475 mL	22.0951 mL
		5 mM	0.4419 mL	2.2095 mL	4.4190 mL
		10 mM	0.2210 mL	1.1048 mL	2.2095 mL
* 请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时, 请在 6 个月内使用, -20℃ 储存时, 请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用;					



	以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% EtOH → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 3 mg/mL (6.63 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 3 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 30.0 mg/mL 的澄清 EtOH 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂ O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% EtOH → 90% (20% SBE-β -CD in Saline) Solubility: ≥ 3 mg/mL (6.63 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 3 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 30.0 mg/mL 的澄清 EtOH 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β -CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β -CD（磺丁基醚 β -环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% EtOH → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 3 mg/mL (6.63 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 3 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 30.0 mg/mL 的澄清 EtOH 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
参考文献	[1]. Stambler BS, et al. Etipamil Nasal Spray for Rapid Conversion of Supraventricular Tachycardia to Sinus Rhythm. J Am Coll Cardiol. 2018 Jul 31;72(5):489-497. [2]. Milestone Pharmaceuticals Announces USAN Approval of Generic Name “Etipamil” for its Phase 2 Clinical Development Product for the Treatment of Paroxysmal Supraventricular Tachycardia. [3]. Ascah A, et al. Cardiovascular and Pharmacokinetic Profiles of Intravenous Etipamil in Conscious Telemetered Cynomolgus Monkeys. Int J Toxicol. 2025 Apr 1:10915818251327963. [4]. Pion J, et al. Preclinical Safety Evaluation of Etipamil Nasal Spray in Cynomolgus Macaques (Macaca fascicularis) to Assess for Safety in Patients With Paroxysmal Supraventricular Tachycardia. Int J Toxicol. 2024 Sep-Oct;43(5):503-510.

完整储备液配制表：

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80°C, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时，请在 6 个月内使用， -20°C 储存时，请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积 浓度				
DMSO	1 mM	2.2095 mL	11.0475 mL	22.0951 mL	55.2376 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	5 mM	0.4419 mL	2.2095 mL	4.4190 mL	11.0475 mL
	10 mM	0.2210 mL	1.1048 mL	2.2095 mL	5.5238 mL
	15 mM	0.1473 mL	0.7365 mL	1.4730 mL	3.6825 mL
	20 mM	0.1105 mL	0.5524 mL	1.1048 mL	2.7619 mL
	25 mM	0.0884 mL	0.4419 mL	0.8838 mL	2.2095 mL
	30 mM	0.0737 mL	0.3683 mL	0.7365 mL	1.8413 mL
	40 mM	0.0552 mL	0.2762 mL	0.5524 mL	1.3809 mL
	50 mM	0.0442 mL	0.2210 mL	0.4419 mL	1.1048 mL
	60 mM	0.0368 mL	0.1841 mL	0.3683 mL	0.9206 mL
	80 mM	0.0276 mL	0.1381 mL	0.2762 mL	0.6905 mL
	100 mM	0.0221 mL	0.1105 mL	0.2210 mL	0.5524 mL

